

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関
国際事務局



(43)国際公開日
2005年2月10日 (10.02.2005)

PCT

(10)国際公開番号
WO 2005/011683 A1

(51)国際特許分類: A61K 31/4174, 9/70, 47/06, 47/10,
47/12, 47/14, 47/30, 47/44, A61P 13/10, C07D 233/61

(74)代理人: 岸田正行, 外(KISHIDA, Masayuki et al.);
〒1000005 東京都千代田区丸の内2丁目6番2号丸
の内八重洲ビル424号 Tokyo (JP).

(21)国際出願番号: PCT/JP2004/011068

(22)国際出願日: 2004年8月3日 (03.08.2004)

(25)国際出願の言語: 日本語

(26)国際公開の言語: 日本語

(30)優先権データ:
特願2003-286103 2003年8月4日 (04.08.2003) JP

(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 杏林
製薬株式会社 (KYORIN PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒1018311 東京都千代田区神田駿河台
2丁目5番地 Tokyo (JP).

(72)発明者; および

(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 中嶋堅
(NAKASHIMA, Katashi) [JP/JP]; 〒3740016 群馬
県館林市松原2-14-19 Gunma (JP). 大森悟
史 (OHMORI, Satoshi) [JP/JP]; 〒3280051 栃木
県栃木市柳橋町20-12 Tochigi (JP). 金山範洋
(KANAYAMA, Norihiro) [JP/JP]; 〒3290101 栃木
県下都賀郡野木町友沼6095 Tochigi (JP). 酒井芳紀
(SAKAI, Yoshiki) [JP/JP]; 〒6188585 大阪府三島郡島
本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社
Osaka (JP).

(81)指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84)指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: TRANSDERMAL ABSORPTION PREPARATION

(54)発明の名称: 経皮吸収型製剤

WO 2005/011683 A1

(57)Abstract: [PROBLEMS] To provide a transdermal absorption preparation with little skin irritation whereby 4-(2-methyl-1-imidazolyl)-2,2-diphenylbutylamide (KRP-197), which is scarcely absorbed via the skin and has antagonism to bladder-selective muscarine receptors M3 and M1, can be continuously and efficiently absorbed into the body via the skin so that a sustained efficacy can be obtained while showing little side effects. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] A transdermal absorption preparation is formed by flattening, drying or accumulating a composition comprising KRP-197 and an external preparation base to give a transdermal absorption preparation of the pressure-sensitive single layer type or a transdermal absorption preparation of the reservoir type. Thus, a preparation being excellent in the skin permeation of KRP-197 and sustained absorption thereof into the body and showing little skin irritation can be provided.

(57)要約: 【課題】皮膚からの吸収性の低い、膀胱に選択性のあるムスカリ受容体M3及びM1拮抗作用を有する4-(2-メチル-1-イミダゾリル)-2,2-ジフェニルブチルアミド(KRP-197)を、皮膚から持続的かつ効率良く体内へ吸収させることにより、副作用発現が少なく持続的な有効性が得られ、しかも皮膚刺激性の低い経皮吸収型製剤を提供する。【解決手段】KRP-197と外用剤基剤からなる組成物を、経皮吸収製剤構造形成体に展延・乾燥、あるいは貯留し、粘着単層型経皮吸収製剤或いはリザーバー型経皮吸収製剤とすることにより、KRP-197の皮膚透過性及び持続的な体内吸収性に優れ、かつ皮膚刺激性の低い製剤が提供された。